

Rec'd PCT/PTO 10 JUN 2005

10038277

(12) SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA EN VIRTUD DEL TRATADO DE COOPERACIÓN  
EN MATERIA DE PATENTES (PCT)

(19) Organización Mundial de la Propiedad  
Intelectual  
Oficina internacional



ARTICLE 19 AMENDMENT



(43) Fecha de publicación internacional  
1 de Julio de 2004 (01.07.2004)

PCT

(10) Número de Publicación Internacional  
WO 2004/054600 A1

- (51) Clasificación Internacional de Patentes<sup>7</sup>: A61K 35/78, A61P 1/18
- (21) Número de la solicitud internacional:  
PCT/MX2003/000108
- (22) Fecha de presentación internacional:  
11 de Diciembre de 2003 (11.12.2003)
- (25) Idioma de presentación: español
- (26) Idioma de publicación: español
- (30) Datos relativos a la prioridad:  
PA/a/2002/012315  
13 de Diciembre de 2002 (13.12.2002) MX
- (71) Solicitante (*para todos los Estados designados salvo US*): UNIVERSIDAD AUTÓNOMA METROPOLITANA [MX/MX]; Prolongación Canal de Miramontes 3855, Colonia Ex-Hacienda de San Juan de Dios, México, D.F., C.P. 14387 (MX).
- (72) Inventor; e
- (75) Inventor/Solicitante (*para US solamente*): SOTO PEREDO, Claudia, Angélica [MX/MX]; Manzana 6, Grupo 1, Casa 2, Colonia Unidad Santa Fe, México, D.F., C.P. 01170 (MX).
- (74) Mandatario: PÉREZ SALAZAR, Sara; Prolongación Canal de Miramontes 3855, Colonia Ex-Hacienda de San Juan de Dios, México, D.F., C.P. 14387 (MX).
- (81) Estados designados (*nacional*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Estados designados (*regional*): patente ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), patente euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), patente europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), patente OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Declaración según la Regla 4.17:

— sobre la calidad de inventor (Regla 4.17(iv)) sólo para US

Publicada:

— con informe de búsqueda internacional  
— con reivindicaciones modificadas

Fecha de publicación de las reivindicaciones modificadas:  
2 de Septiembre de 2004

Para códigos de dos letras y otras abreviaturas, véase la sección "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" que aparece al principio de cada número regular de la Gaceta del PCT.

(54) Title: PHARMACEUTICAL COMPOUND CONTAINING SILYMARIN AND CARBOPOL®, PRODUCTION METHOD THEREOF AND USE OF SAME AS A REGENERATOR OF TISSUE AND PANCREATIC CELLS WITH ENDOGENOUS SECRETION DAMAGED BY DIABETES MELLITUS

(54) Título: COMPUESTO FARMACÉUTICO QUE CONTIENE SILIMARINA Y CARBOPOL®, SU PROCESO DE FABRICACIÓN Y SU USO COMO REGENERADOR DEL TEJIDO Y CÉLULAS PANCREÁTICAS DE SECRECIÓN ENDÓGENA DAÑADOS POR DIABETES MELLITUS

(57) Abstract: The invention relates to a novel compound containing silymarin and Carbopol® for the treatment of diabetes mellitus. The inventive compound morphologically and structurally regenerates the damaged part of the pancreatic tissue in diabetes mellitus and regenerates the insulin-producing pancreatic cells (β cells). In this way, the compound regulates the serum levels of said hormone. Moreover, the compound restores and maintains normal blood glucose levels concentrations.

(57) Resumen: La presente invención se refiere a un nuevo compuesto que contiene Silimarina con Carbopol® para el tratamiento de la Diabetes Mellitus. Este compuesto regenera morfológica y estructuralmente el daño que se presenta en el tejido pancreático en la Diabetes Mellitus, regenera las células pancreáticas productoras de insulina (células β). Por lo tanto regula los niveles séricos de esta hormona. Así mismo, restaura y mantiene las concentraciones normales de la glucosa sanguínea.

WO 2004/054600 A1

## REIVINDICACIONES MODIFICADAS

[Recibidas por la Oficina Internacional el 12 de julio de 2004 (12.07.04):  
reivindicaciones 1 y 17, modificadas, reivindicación 9, nueva]

Habiendo descrito la invención, se considera como una novedad y por lo tanto se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes cláusulas:

5

1.- Composición farmacéutica caracterizada porque contiene Silimarina y Carbopol y un vehículo farmaceúticamente aceptable.

10 2.-Composición de acuerdo a la reivindicación 1 caracterizada por contener Silimarina del 3 al 7% y Carbopol del 0.2 al 0.6 %.

3.- Composición de acuerdo a la reivindicación 2 donde preferentemente contiene Silimarina en 5% y Carbopol en 0.5%.

15 4.- Composición de acuerdo a las reivindicaciones 1 a 3 donde la composición farmacéutica puede estar en forma de dosis oral.

20 5.- Composición de acuerdo a la reivindicación 4 donde como forma oral puede ser suspensión, solución oral, emulsión, gel, cápsula de gelatina dura, cápsula de gelatina blanda, tableta de liberación inmediata, tableta de liberación controlada, tableta de liberación prolongada, tableta de liberación sostenida.

6.- Composición de acuerdo a la reivindicación 5 donde se prefiere en forma de suspensión oral.

25

7.- El uso de la composición de la reinvindicación 1 a base de Silimarina y Carbopol para la fabricación de un medicamento útil en la regeneración de las células pancreáticas dañadas para la recuperación de la función endocrina pancreática.

30

8.- El uso de acuerdo a la reivindicación 7 donde el funcionamiento de las células  $\beta$  pancreáticas provocan la producción de Insulina.

35

9.- El uso de acuerdo a la reivindicación 8 donde el medicamento es útil para el tratamiento de la diabetes mellitus.

10.- Procedimiento para la obtención de la composición de las reivindicaciones 1 a 3 que consta de los pasos:

- 5        a) Disolución del 0.2 al 0.6 % de Carbopol en agua desionizada sometiéndola a agitación por un período de tiempo de 50 a 90 minutos.
- b) Adición de Silimarina en un porcentaje del 3 al 7 a la disolución anterior y se somete a agitación por un período mínimo de una hora hasta lograr una mezcla homogénea.

10      11.- Procedimiento de acuerdo a la reivindicación 9 donde preferentemente se disuelve 0.5% de Carbopol y 5% de Silimarina.

12.- Proceso de acuerdo a la reivindicación 9 donde opcionalmente tiene un paso posterior de solubilización.

15      13.- Proceso de acuerdo a la reivindicación 9 donde opcionalmente tiene un paso posterior de emulsificación.

20      14.- Proceso de acuerdo a la reivindicación 9 donde opcionalmente tiene un proceso de gelificación.

15.- Proceso de acuerdo a la reivindicación 9 donde opcionalmente tiene un proceso de encapsulación.

25      16.- Proceso de acuerdo a la reivindicación 9 donde opcionalmente tiene un proceso de tableteado.

17.- El uso de acuerdo a las reivindicaciones 7, 8 y 9 donde la dosis de administración va de 60 a 220 mg/Kg.

30      18.- Uso de acuerdo a la reivindicaciones 11 a la 15 donde la dosis preferida es de 200 mg/Kg.